

⑩ 日本国特許庁 (JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭55-124763

⑬ Int. Cl.³
C 07 D 213/64
213/70

識別記号
7138-4C
7138-4C

⑭ 公開 昭和55年(1980)9月26日
発明の数 1
査定請求 未請求

(全 3 頁)

⑮ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体
⑯ 特願 昭54-32068
⑰ 出願 昭54(1979)3月19日
⑱ 発明者 西山隆三
高槻市真上町5丁目41番22号
⑲ 発明者 畠川敬一
守山市浮気町321番地の31
⑳ 発明者 横道政
草津市野村町221番地

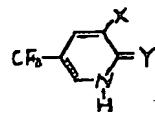
㉑ 発明者 芳賀隆弘
草津市野村町221番地
㉒ 発明者 長谷邦昭
守山市浮気町321番地の31
㉓ 発明者 林弘仁
守山市浮気町321番地の31
㉔ 出願人 石原産業株式会社
大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

明　　図　　一

1. 発明の名稱 5-トリフルオロメチル-2-
ピリドン誘導体

2. 専用図の範囲

1. 一般式

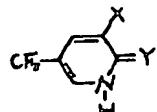


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは二級亜換基又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

3. 発明の範囲を図示

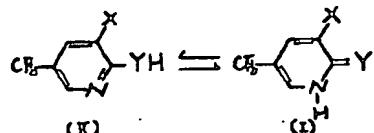
本發明は環、疎環、疎環などの中間環と
して有効で、同様な5-トリフルオロメチル-
2-ピリドン誘導体に適用する。

詳しくは本發明は一般式



(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは二級亜換基又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

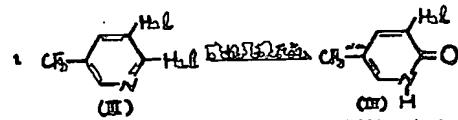
図1-一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-
ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性
として存在することができる。



(式中X及びYは前述の通りである)

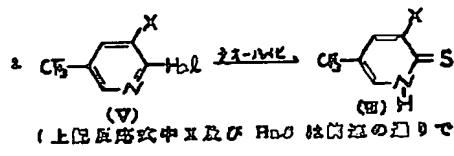
図1-一般式(I)において、Xで表わされるハロ
ゲン原子としては溴、碘、臭素、氟素が考
えられる。

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ヒドロピリドンの合成は、例えば下記方法によって行なわれる。



(上記反応式中 Hg²⁺ はハロゲン置換子である)

一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの溶媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ性触媒を用いて 80~150°C, 0.1~1.0 時間で行なわれる。

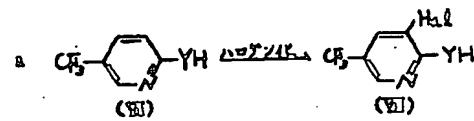


(上記反応式中 X 及び Hg²⁺ は前記の通りである)

一般に上記反応はノタノール、エタノールなどのアルコール中、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの溶媒中、水酸化ナトリウムなどのアルカリ性触媒を用いて 80~150°C, 0.1~1.0 時間で行なわれる。

- 3 -

特許第35-124763(2)
本発明の5-トリフルオロメチル-2-ヒドロピリドンの合成中、テガソダ、臭化ソーダ、テガソソーダ、N,N-ジメチルジカカルバミンソーダなどのテガーメ化剤を用いて 50~100°C, 0.5~1.0 時間で行なわれる。



(上記反応式中 X 及び Hg²⁺ は前記の通りである)

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、酢酸、二酸化炭素、水、水酸化ナトリウムなどの溶媒中、硫黄ガス、臭素、テガニルクロライド、スルフリルクロライドなどのハロゲン化剤を用いて 0~100°C, 0.5~1.0 時間で行なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベンゼンと反応させて 5-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニルウレア類化合物に導かれる。詳しくは本発明化合物の 3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-ヒドロピリドンと 3,5-トリクロロニトロベンゼンと反応して 3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと 2,6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートと反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-N-(3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル)ウレアを得ることができる。このものは有虫の有虫幼虫として即ちた活性を示し、特に有虫成虫の胸筋に有効であって、例えばこの化合物 100ppm を分量投じてペツの幼虫を殺すし、それを処理してそこへ 2~3 倍のコナガの幼虫を放ち、8 日目に生死を判定した結果、100% の

- 4 -



死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。
合成例 1 3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ヒドロピリドン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ヒドロピリドン 2 g をクロロホルム 20 mL に溶解させ、50°C に加熱して硫黄ガスを 1 時間吹き下に通じた。反応終了後、クロロホルムを回収し、トルエン-エーテル-ヘキサンの混合溶媒で浮遊させて温度 140~147°C の目的物 0.15 g を得た。

(B)

水酸化ナトリウム 2.4 g を水 128 mL に溶解させた後、2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルピリジン 4.0 g を丸め、更にジメチルスルホキシド 12.5 mL を加えて溶解し、130°C で 1 時間吹き下に反応させた。反応終了後、水を加え、水相で抽出にして洗浄を繰り返し、このものを濃縮して目的物 2.6

- 5 -

- 6 -

を得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-チオ
ヒドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルヒドン4タとチオ尿素167タとをエタノール30mlに溶解させ、加熱して還流状態で3時間攪拌下に反応させた。その後、本酸化カリウム水溶液123タを徐々に加えて還流状態で1時間反応させた。反応終了後、生成物を放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次いで、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレンを除去して融点147~150℃の目的物2.1タを得た。

合成例 3 3-プロモ-5-トリフルオロメチル-2-ヒドン

5-トリフルオロメチル-2-ヒドン0.4タを酢酸10mlに溶解させ、そこへ臭素0.4タを加えて攪拌下で4時間反応させた。反

特開昭55-124763(3)

应終了後、酢酸を除去し、塩化メチレン-ローヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点162~165℃の目的物0.45タを得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-チオヒドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルヒドン4タに代えて2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルヒジン4.75タを用いる以外は前記合成例2と同様にして反応を行ない、後処理を行なって融点125~128℃の目的物1.9タを得た。

特許出願人 石原産業株式会社